

(19)



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets



(11) Veröffentlichungsnummer: **0 657 440 A1**

(12)

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: **94119100.9**

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>: **C07D 263/24, A61K 31/42,  
C07D 413/04, C07D 413/10**

(22) Anmeldetag: **03.12.94**

(30) Priorität: **13.12.93 CH 3701/93  
27.09.94 CH 2927/94**

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
**14.06.95 Patentblatt 95/24**

(84) Benannte Vertragsstaaten:  
**AT BE CH DE DK ES FR GB GR IE IT LI LU MC  
NL PT SE**

(71) Anmelder: **F. HOFFMANN-LA ROCHE AG  
Postfach 3255  
CH-4002 Basel (CH)**

(72) Erfinder: **Borgulya, Janos  
29 Schwarzwaldallee**

**CH-4058 Basel (DE)**

Erfinder: **Bruderer, Hans  
4 Schulgasse**

**CH-4105 Biel-Benken (DE)**

Erfinder: **Jakob-Roetne, Roland**

**37 Oberer Baselblick**

**D-79594 Inzlingen (DE)**

Erfinder: **Röver, Stephan**

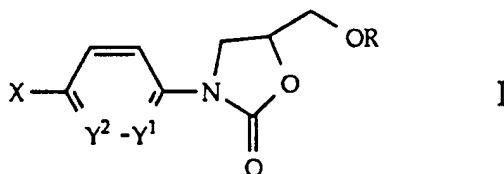
**12 Hasenrichte**

**D-79639 Grenzach-Wyhlen (DE)**

(74) Vertreter: **Poppe, Regina et al  
Postfach 3255  
CH-4002 Basel (CH)**

(54) **Oxazolidin-2-on-Derivate.**

(57) Die Erfindung betrifft Oxazolidin-2-on-Derivate der allgemeinen Formel



worin

R Wasserstoff oder niederes Alkyl;

X Cycloalkenyl; Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, ggf. substituiert durch Phenyl-2-oxo-5-methoxymethyl-oxazolidinyl; Bicyclo[2.2.1]-hept-5-en-2-yl; Adamantyl; oder Cycloalkyl oder Piperidin, gegebenenfalls einfach oder mehrfach substituiert durch Halogen, Amino, niederes Alkyl, Nitril, eine Oxo-Gruppe, Hydroxyimino, Ethylendioxy

oder durch -OR<sup>1</sup>, worin

R<sup>1</sup> -CH(C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, niederes Alkyl, Wasserstoff, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NHCOCH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NH<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>SOCH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CN, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>SCH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CO-niederes-Alkyl, -COC<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, ggf. substituiert durch eine Oxazolidinyl-Gruppe;

oder durch =CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, worin

R<sup>2</sup> Wasserstoff oder niederes Alkyl;

R<sup>3</sup> Wasserstoff, Nitril, niederes Alkyl, Phenyl oder COO-niederes-Alkyl;

oder durch -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>4</sup>, worin

R<sup>4</sup> Nitril, Amino, -NHCOCH<sub>3</sub>, -COC<sub>6</sub>H<sub>5</sub> Hal, Phenyl oder Hydroxy;

EP 0 657 440 A1